

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

NOTIFICATION OF ELECTION

(PCT Rule 61.2)

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

Commissioner
 US Department of Commerce
 United States Patent and Trademark
 Office, PCT
 2011 South Clark Place Room
 CP2/5C24
 Arlington, VA 22202
 ETATS-UNIS D'AMERIQUE

in its capacity as elected Office

| | |
|---|---|
| Date of mailing (day/month/year) 06 November 2000 (06.11.00) | |
| International application No. PCT/JP00/01728 | Applicant's or agent's file reference 09352 |
| International filing date (day/month/year) 21 March 2000 (21.03.00) | Priority date (day/month/year) 25 March 1999 (25.03.99) |
| Applicant IIZUKA, Kunihiko et al | |

1. The designated Office is hereby notified of its election made:

☒ in the demand filed with the International Preliminary Examining Authority on:

14 September 2000 (14.09.00)

☐ in a notice effecting later election filed with the International Bureau on:2. The election ☒ was☐ was not

made before the expiration of 19 months from the priority date or, where Rule 32 applies, within the time limit under Rule 32.2(b).

| | |
|--|--|
| The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland | Authorized officer Henrik Nyberg |
| Facsimile No.: (41-22) 740.14.35 | Telephone No.: (41-22) 338.83.38 |

PATENT COOPERATION TREATY

CORRECTED

VERSION^{PCT}

NOTIFICATION OF THE RECORDING
OF A CHANGE

(PCT Rule 92bis.1 and
Administrative Instructions, Section 422)

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

TAKASHIMA, Hajime
Yuki Bldg.
3-9, Hiranomachi 3-chome, Chuo-ku
Osaka-shi, Osaka 541-0046
JAPON

| | |
|---|--|
| Date of mailing (day/month/year) 27 November 2000 (27.11.00) | IMPORTANT NOTIFICATION |
| Applicant's or agent's file reference 09352 | |
| International application No. PCT/JP00/01728 | International filing date (day/month/year) 21 March 2000 (21.03.00) |

1. The following indications appeared on record concerning:

☒ the applicant ☒ the inventor ☐ the agent ☐ the common representative

Name and Address

UEHATA, Masayoshi
Welfide Corporation Drug Discovery
laboratories
25-1, Shodaiohtani 2-chome
Hirakata-shi, Osaka 573-1153
Japan

State of Nationality

JP

State of Residence

JP

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

2. The International Bureau hereby notifies the applicant that the following change has been recorded concerning:

☐ the person ☐ the name ☒ the address ☐ the nationality ☐ the residence

Name and Address

UEHATA, Masayoshi
Welfide Corporation
Drug Discovery Laboratories
25-1, Shodaiohtani 2-chome
Hirakata-shi, Osaka 573-1153
Japan

State of Nationality

JP

State of Residence

JP

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

3. Further observations, if necessary:

4. A copy of this notification has been sent to:

☒ the receiving Office ☐ the designated Offices concerned
☐ the International Searching Authority ☒ the elected Offices concerned
☒ the International Preliminary Examining Authority ☐ other:

The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Facsimile No.: (41-22) 740.14.35

Authorized officer

Y. KUWAHARA

Telephone No.: (41-22) 338.83.38

PATENT COOPERATION TREATY

1/937221

PCT

From the INTERNATIONAL BUREAU

NOTIFICATION OF THE RECORDING
OF A CHANGE(PCT Rule 92bis.1 and
Administrative Instructions, Section 422)

To:

TAKASHIMA, Hajime
Fujimura Yamato Seimei Building
2-14, Fushimimachi 4-chome
Chuo-ku
Osaka-shi
Osaka 541-0044
JAPON

| | |
|--|---|
| Date of mailing (day/month/year) 07 septembre 2001 (07.09.01) | IMPORTANT NOTIFICATION |
| Applicant's or agent's file reference 09352 | |
| International application No. PCT/JP00/01728 | International filing date (day/month/year) 21 mars 2000 (21.03.00) |

| | | | | | | | | | |
|---|--|----------------------|--------------------|-------------------------------|--|-------------------------------|--|-----------------|--|
| 1. The following indications appeared on record concerning: | | | | | | | | | |
| <input type="checkbox"/> the applicant | <input type="checkbox"/> the inventor <input checked="" type="checkbox"/> the agent <input type="checkbox"/> the common representative | | | | | | | | |
| Name and Address TAKASHIMA, Hajime Yuki Bldg. 3-9, Hiranomachi 3-chome, Chuo-ku Osaka-shi, Osaka 541-0046 Japan | <table border="1"> <tr> <td>State of Nationality</td> <td>State of Residence</td> </tr> <tr> <td colspan="2">Telephone No. 06-6227-1156</td> </tr> <tr> <td colspan="2">Facsimile No. 06-6227-0260</td> </tr> <tr> <td colspan="2">Teleprinter No.</td> </tr> </table> | State of Nationality | State of Residence | Telephone No. 06-6227-1156 | | Facsimile No. 06-6227-0260 | | Teleprinter No. | |
| State of Nationality | State of Residence | | | | | | | | |
| Telephone No. 06-6227-1156 | | | | | | | | | |
| Facsimile No. 06-6227-0260 | | | | | | | | | |
| Teleprinter No. | | | | | | | | | |
| 2. The International Bureau hereby notifies the applicant that the following change has been recorded concerning: | | | | | | | | | |
| <input type="checkbox"/> the person | <input type="checkbox"/> the name <input checked="" type="checkbox"/> the address <input type="checkbox"/> the nationality <input type="checkbox"/> the residence | | | | | | | | |
| Name and Address TAKASHIMA, Hajime Fujimura Yamato Seimei Building 2-14, Fushimimachi 4-chome Chuo-ku Osaka-shi Osaka 541-0044 Japan | <table border="1"> <tr> <td>State of Nationality</td> <td>State of Residence</td> </tr> <tr> <td colspan="2">Telephone No. 06-6227-1156</td> </tr> <tr> <td colspan="2">Facsimile No. 06-6227-0260</td> </tr> <tr> <td colspan="2">Teleprinter No.</td> </tr> </table> | State of Nationality | State of Residence | Telephone No. 06-6227-1156 | | Facsimile No. 06-6227-0260 | | Teleprinter No. | |
| State of Nationality | State of Residence | | | | | | | | |
| Telephone No. 06-6227-1156 | | | | | | | | | |
| Facsimile No. 06-6227-0260 | | | | | | | | | |
| Teleprinter No. | | | | | | | | | |
| 3. Further observations, if necessary: | | | | | | | | | |
| 4. A copy of this notification has been sent to: | | | | | | | | | |
| <input checked="" type="checkbox"/> the receiving Office | <input type="checkbox"/> the designated Offices concerned | | | | | | | | |
| <input type="checkbox"/> the International Searching Authority | <input checked="" type="checkbox"/> the elected Offices concerned | | | | | | | | |
| <input type="checkbox"/> the International Preliminary Examining Authority | <input type="checkbox"/> other: | | | | | | | | |

| | |
|---|--|
| The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland Facsimile No.: (41-22) 740.14.35 | Authorized officer Y. KUWAHARA (41-22) 338.83.38 |
|---|--|

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

NOTIFICATION OF THE RECORDING
OF A CHANGE(PCT Rule 92bis.1 and
Administrative Instructions, Section 422)

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

TAKASHIMA, Hajime
Yuki Bldg.
3-9, Hiranomachi 3-chome, Chuo-ku
Osaka-shi, Osaka 541-0046
JAPON

| | |
|---|--|
| Date of mailing (day/month/year) 27 November 2000 (27.11.00) | IMPORTANT NOTIFICATION |
| Applicant's or agent's file reference 09352 | |
| International application No. PCT/JP00/01728 | International filing date (day/month/year) 21 March 2000 (21.03.00) |

| | | |
|---|---|--|
| 1. The following indications appeared on record concerning: | | |
| <input checked="" type="checkbox"/> the applicant | <input type="checkbox"/> the inventor | <input type="checkbox"/> the agent <input type="checkbox"/> the common representative |
| Name and Address YOSHITOMI PHARMACEUTICAL INDUSTRIES, LTD. 6-9, Hiranomachi 2-chome, Chuo-ku Osaka-shi, Osaka 541-0046 Japan | State of Nationality JP | State of Residence JP |
| | Telephone No. 06-6201-1908 | |
| | Facsimile No. 06-6232-0676 | |
| | Teleprinter No. | |
| 2. The International Bureau hereby notifies the applicant that the following change has been recorded concerning: | | |
| <input type="checkbox"/> the person | <input checked="" type="checkbox"/> the name | <input type="checkbox"/> the address <input type="checkbox"/> the nationality <input type="checkbox"/> the residence |
| Name and Address WELFIDE CORPORATION 6-9, Hiranomachi 2-chome, Chuo-ku Osaka-shi, Osaka 541-0046 Japan | State of Nationality JP | State of Residence JP |
| | Telephone No. 06-6201-1908 | |
| | Facsimile No. 06-6232-0676 | |
| | Teleprinter No. | |
| 3. Further observations, if necessary: | | |
| 4. A copy of this notification has been sent to: | | |
| <input checked="" type="checkbox"/> the receiving Office | <input type="checkbox"/> the designated Offices concerned | |
| <input type="checkbox"/> the International Searching Authority | <input checked="" type="checkbox"/> the elected Offices concerned | |
| <input checked="" type="checkbox"/> the International Preliminary Examining Authority | <input type="checkbox"/> other: | |

| | |
|---|---------------------------------------|
| The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland | Authorized officer Sean Taylor |
| Facsimile No.: (41-22) 740.14.35 | Telephone No.: (41-22) 338.83.38 |

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

NOTIFICATION OF THE RECORDING
OF A CHANGE(PCT Rule 92bis.1 and
Administrative Instructions, Section 422)

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

TAKASHIMA, Hajime
Yuki Bldg.
3-9, Hiranomachi 3-chome, Chuo-ku
Osaka-shi, Osaka 541-0046
JAPON

| | |
|---|--|
| Date of mailing (day/month/year) 27 November 2000 (27.11.00) | IMPORTANT NOTIFICATION |
| Applicant's or agent's file reference 09352 | |
| International application No. PCT/JP00/01728 | International filing date (day/month/year) 21 March 2000 (21.03.00) |

| | | |
|--|---|---|
| 1. The following indications appeared on record concerning: | | |
| <input checked="" type="checkbox"/> the applicant | <input checked="" type="checkbox"/> the inventor | <input type="checkbox"/> the agent <input type="checkbox"/> the common representative |
| Name and Address UEHATA, Masayoshi Yoshitomi Pharmaceutical Industries, Ltd., Research Laboratories 25-1, Shodaiohtani 2-chome Hirakata-shi, Osaka 573-1153 Japan | State of Nationality JP | State of Residence JP |
| | Telephone No. | |
| | Facsimile No. | |
| | Teleprinter No. | |
| 2. The International Bureau hereby notifies the applicant that the following change has been recorded concerning: | | |
| <input type="checkbox"/> the person | <input type="checkbox"/> the name | <input checked="" type="checkbox"/> the address <input type="checkbox"/> the nationality <input type="checkbox"/> the residence |
| Name and Address UEHATA, Masayoshi Welfide Corporation Drug Discovery laboratories 25-1, Shodaiohtani 2-chome Hirakata-shi, Osaka 573-1153 Japan | State of Nationality JP | State of Residence JP |
| | Telephone No. | |
| | Facsimile No. | |
| | Teleprinter No. | |
| 3. Further observations, if necessary: | | |
| 4. A copy of this notification has been sent to: | | |
| <input checked="" type="checkbox"/> the receiving Office | <input type="checkbox"/> the designated Offices concerned | |
| <input type="checkbox"/> the International Searching Authority | <input checked="" type="checkbox"/> the elected Offices concerned | |
| <input checked="" type="checkbox"/> the International Preliminary Examining Authority | <input type="checkbox"/> other: | |

| | |
|---|---------------------------------------|
| The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland | Authorized officer Sean Taylor |
| Facsimile No.: (41-22) 740.14.35 | Telephone No.: (41-22) 338.83.38 |

11T
29/987221
Translation
5000

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

| | | |
|--|---|--|
| Applicant's or agent's file reference 09352 | FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416) | |
| International application No. PCT/JP00/01728 | International filing date (day/month/year) 21 March 2000 (21.03.00) | Priority date (day/month/year) 25 March 1999 (25.03.99) |
| International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC A61K 45/00, 31/34, 31/44, 31/443, 31/445, 31/4525, 31/50, 31/501, A61P 11/00 | | |
| Applicant WELFIDE CORPORATION | | |

| | |
|--|---|
| 1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36. | |
| 2. This REPORT consists of a total of <u>6</u> sheets, including this cover sheet. | |
| <input type="checkbox"/> This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT). | |
| These annexes consist of a total of _____ sheets. | |
| 3. This report contains indications relating to the following items: | |
| I <input checked="" type="checkbox"/> | Basis of the report |
| II <input type="checkbox"/> | Priority |
| III <input checked="" type="checkbox"/> | Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability |
| IV <input type="checkbox"/> | Lack of unity of invention |
| V <input checked="" type="checkbox"/> | Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement |
| VI <input type="checkbox"/> | Certain documents cited |
| VII <input type="checkbox"/> | Certain defects in the international application |
| VIII <input type="checkbox"/> | Certain observations on the international application |

| | |
|--|---|
| Date of submission of the demand 14 September 2000 (14.09.00) | Date of completion of this report 08 May 2001 (08.05.2001) |
| Name and mailing address of the IPEA/JP | Authorized officer |
| Facsimile No. | Telephone No. |

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/JP00/01728

I. Basis of the report

1. With regard to the elements of the international application:*

- ☒ the international application as originally filed
- ☐ the description:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the claims:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, as amended (together with any statement under Article 19
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the drawings:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the sequence listing part of the description:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____

2. With regard to the language, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item.

These elements were available or furnished to this Authority in the following language _____ which is:

- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of international search (under Rule 23.1(b)).
- ☐ the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b)).
- ☐ the language of the translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and/or 55.3).

3. With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing:

- ☐ contained in the international application in written form.
- ☒ filed together with the international application in computer readable form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in written form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in computer readable form.
- ☐ The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.
- ☒ The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished.

4. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages _____
- ☐ the claims, Nos. _____
- ☐ the drawings, sheets/fig _____

5. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).**

* Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rule 70.16 and 70.17).

** Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.

III. Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability

1. The questions whether the claimed invention appears to be novel, to involve an inventive step (to be non obvious), or to be industrially applicable have not been examined in respect of:

☐ the entire international application.

☒ claims Nos. 11-15

because:

☒ the said international application, or the said claims Nos. 11-15
relate to the following subject matter which does not require an international preliminary examination (*specify*):

See supplemental sheet for continuation of Box III. 1.

☐ the description, claims or drawings (*indicate particular elements below*) or said claims Nos. _____
are so unclear that no meaningful opinion could be formed (*specify*):

☐ the claims, or said claims Nos. _____ are so inadequately supported
by the description that no meaningful opinion could be formed.

☒ no international search report has been established for said claims Nos. 11-15.

2. A meaningful international preliminary examination cannot be carried out due to the failure of the nucleotide and/or amino acid sequence listing to comply with the standard provided for in Annex C of the Administrative Instructions:

☐ the written form has not been furnished or does not comply with the standard.

☐ the computer readable form has not been furnished or does not comply with the standard.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.
PCT/JP 00/01728

Supplemental Box

(To be used when the space in any of the preceding boxes is not sufficient)

Continuation of: III. 1.

Claims 11 to 15 pertain to methods for treatment of the human body by therapy or surgery (PCT Article 34(4)(a)(i) and PCT Rule 67(iv)).

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.
PCT/JP 00/01728

V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

1. Statement

| | | | |
|-------------------------------|--------|-------------|-----|
| Novelty (N) | Claims | 1-10, 16-21 | YES |
| | Claims | | NO |
| Inventive step (IS) | Claims | | YES |
| | Claims | 1-10, 16-21 | NO |
| Industrial applicability (IA) | Claims | 1-10, 16-21 | YES |
| | Claims | | NO |

2. Citations and explanations

This written opinion was based on the documents listed below:

- Document 1: WO, 98/06433, A1 (Yoshitomi Pharmaceutical Ind., Ltd.)
- Document 2: JP, 10-113187, A (Kirin Brewery Co., Ltd.)
- Document 3: EP, 893437, A1 (Ono Pharmaceutical Co., Ltd.)
- Document 4: EP, 784980, A1 (Nakamura, Toshikazu)
- Document 5: EP, 519354, A1 (Fujisawa Pharmaceutical Co., Ltd.)
- Document 6: JP, 6-345643, A (Hoechst AG),
- Document 7: JP, 61-158983, A (Yoshitomi Pharmaceutical Ind. Ltd.)
- Document 8: JP, 2-290821, A (Pias Arise K.K.)
- Document 9: JP, 10-218768, A (Asahi Chemical Ind. Co., Ltd.)

Concerning Claims 1 to 10 and 16 to 21

Document 1 (claims; page 4, lines 8 to 18; page 16, line 21 to page 18, line 11; page 28, line 17 to page 49, line 17; and page 54, line 16 to page 55, line 21) discloses a drug having as the active ingredient an Rho kinase inhibitor and also discloses specific medical uses, its formulation, as well as the chemical structure of the active ingredient and indicates which of these is most

desirable. Moreover, Document 2 (claims; and paragraphs [0089] to [0108]) discloses a protein which inhibits the Rho kinase function and a drug using said protein, its formulation and a specific medical use thereof. In comparing the invention disclosed in Claims 1 to 10 and Claims 16 to 21 of this application with the inventions disclosed in Documents 1 and 2, the inventions differ in the sense that the invention of the present application is used in the prevention/treatment of interstitial pneumonia and pulmonary fibrosis and contains documentation which indicates for what diseases the invention can and should be used, whereas Documents 1 and 2 do not mention these diseases.

However, the fact that the drug useful for specific diseases disclosed in Documents 1 and 2 is useful in the prevention/treatment of interstitial pneumonia and pulmonary fibrosis is a commonly known fact, as described in Documents 3 to 9. Therefore, it would not required any creative ability above that expected of a person skilled in the art to realise that an Rho kinase inhibitor can be used in the prevention/treatment of interstitial pneumonia and pulmonary fibrosis. Furthermore, with respect to the documentation, a drug package is commonly used and is a form commonly adopted by a person skilled in the art.

Therefore, the invention disclosed in Claims 1 to 10 and 16 to 21 does not involve an inventive step.

PCT

国際予備審査報告

(法第12条、法施行規則第56条)
〔PCT36条及びPCT規則70〕

REC'D 28 MAY 2001


WIPO

PCT

14T

| | | |
|--|---|-------------------------|
| 出願人又は代理人 の書類記号 09352 | 今後の手続きについては、国際予備審査報告の送付通知（様式PCT/ IPEA/416）を参照すること。 | |
| 国際出願番号 PCT/JPO0/01728 | 国際出願日 (日.月.年) 21.03.00 | 優先日 (日.月.年) 25.03.99 |
| 国際特許分類 (IPC) Int.Cl ⁷ A61K45/00, 31/34, 31/44, 31/443, 31/445, A61K31/4525, 31/50, 31/501, A61P11/00 | | |
| 出願人 (氏名又は名称) ウエルファイド株式会社 | | |

- 国際予備審査機関が作成したこの国際予備審査報告を法施行規則第57条（PCT36条）の規定に従い送付する。
- この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 4 ページからなる。
☐ この国際予備審査報告には、附属書類、つまり補正されて、この報告の基礎とされた及び／又はこの国際予備審査機関に対してした訂正を含む明細書、請求の範囲及び／又は図面も添付されている。
(PCT規則70.16及びPCT実施細則第607号参照)
この附属書類は、全部で ページである。
- この国際予備審査報告は、次の内容を含む。
 - ☒ 国際予備審査報告の基礎
 - ☐ 優先権
 - ☒ 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成
 - ☐ 発明の単一性の欠如
 - ☒ PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
 - ☐ ある種の引用文献
 - ☐ 国際出願の不備
 - ☐ 国際出願に対する意見

| | | |
|--|--|---------|
| 国際予備審査の請求書を受理した日 14.09.00 | 国際予備審査報告を作成した日 08.05.01 | |
| 名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号 | 特許庁審査官 (権限のある職員) 荒木 英 則  | 4C 9736 |
| 電話番号 03-3581-1101 内線 3450 | | |

I. 国際予備審査報告の基礎

1. この国際予備審査報告は下記の出願書類に基づいて作成された。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に
応答するために提出された差し替え用紙は、この報告書において「出願時」とし、本報告書には添付しない。
PCT規則70.16, 70.17)

☒ 出願時の国際出願書類

- ☐ 明細書 第 _____ ページ、 出願時に提出されたもの
明細書 第 _____ ページ、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
明細書 第 _____ ページ、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの
- ☐ 請求の範囲 第 _____ 項、 出願時に提出されたもの
請求の範囲 第 _____ 項、 PCT19条の規定に基づき補正されたもの
請求の範囲 第 _____ 項、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
請求の範囲 第 _____ 項、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの
- ☐ 図面 第 _____ ページ/図、 出願時に提出されたもの
図面 第 _____ ページ/図、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
図面 第 _____ ページ/図、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの
- ☐ 明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 出願時に提出されたもの
明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの

2. 上記の出願書類の言語は、下記に示す場合を除くほか、この国際出願の言語である。

上記の書類は、下記の言語である _____ 語である。

- ☐ 国際調査のために提出されたPCT規則23.1(b)にいう翻訳文の言語
☐ PCT規則48.3(b)にいう国際公開の言語
☐ 国際予備審査のために提出されたPCT規則55.2または55.3にいう翻訳文の言語
3. この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき国際予備審査報告を行った。

- ☐ この国際出願に含まれる書面による配列表
☒ この国際出願と共に提出されたフレキシブルディスクによる配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された書面による配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出されたフレキシブルディスクによる配列表
☐ 出願後に提出した書面による配列表が出願時における国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった
☒ 書面による配列表に記載した配列とフレキシブルディスクによる配列表に記載した配列が同一である旨の陳述書の提出があった。

4. 補正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 図面の第 _____ ページ/図

5. ☐ この国際予備審査報告は、補充欄に示したように、補正が出願時における開示の範囲を越えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c) この補正を含む差し替え用紙は上記1.における判断の際に考慮しなければならず、本報告に添付する。)

1. 次に、次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

- ☒ 請求の範囲 11-15

X この国際願又は請求の範囲 11-15 は、国際予備審査をすることを要しない
次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

☐ 明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲 _____ の記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

- ☐ 全部の請求の範囲又は請求の範囲 _____ が、明細書による十分な裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

- ☒ 請求の範囲 11-15 について、国際調査報告が作成されていない。

- ☐ フレキシブルディスクによる配列表が提出されていない又は所定の基準を満たしていない。

V. 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条（PCT35条(2)）に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

| | | | |
|----------------|-------|-------------|---|
| 新規性 (N) | 請求の範囲 | 1-10, 16-21 | 有 |
| | 請求の範囲 | | 無 |
| 進歩性 (IS) | 請求の範囲 | | 有 |
| | 請求の範囲 | 1-10, 16-21 | 無 |
| 産業上の利用可能性 (IA) | 請求の範囲 | 1-10, 16-21 | 有 |
| | 請求の範囲 | | 無 |

2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

見解は、以下の文献に基づいて示される。

- 文献1: WO, 98/06433, A1 (吉富製薬株式会社)
 文献2: JP, 10-113187, A (麒麟麦酒株式会社)
 文献3: EP, 893437, A1 (ONO PHARMACEUTICAL CO., LTD.)
 文献4: EP, 784980, A1 (NAKAMURA, Toshikazu)
 文献5: EP, 519354, A1 (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO., LTD.)
 文献6: JP, 6-345643, A (ヘキスト・アクチェンゲゼルシャフト)
 文献7: JP, 61-158983, A (吉富製薬株式会社)
 文献8: JP, 2-290821, A (ピアス株式会社)
 文献9: JP, 10-218768, A (旭化成工業株式会社)

○請求の範囲1-10及び16-21について

文献1の特許請求の範囲、第4頁8-18行、第16頁21行-第18頁11行、第28頁17行-第49頁17行及び第54頁16行-第55頁21行には、Rhoキナーゼ阻害剤を有効成分とする医薬が、具体的な医薬の用途、その製剤化並びに具体的な有効成分の化学構造及びその中で好ましいとされるものについて記載されている。また文献2特許請求の範囲及び【0089】段落ないし【0108】段落には、Rhoキナーゼの機能を阻害するタンパク質及び該タンパク質を用いた医薬、その製剤化及び具体的な医薬の用途について記載されている。そして本願の請求の範囲1-10及び16-21に係る発明と文献1及び2に記載されたものを比較すると、本願では間質性肺炎・肺線維症の予防・治療に用いるものであり、また該適応疾患に対し使用しうるかまたは使用すべきであることを記載した書類を含むものであるとされるものであるのに対し、文献1及び2にはこれらの疾患について記載されておらず、この点で相違する。

しかしながら、文献1及び2に記載されている具体的な疾患に有用な医薬が間質性肺炎や肺線維症の予防・治療に有用であることは文献3ないし9にもあるように広く知られている事項であるから、文献1及び2に記載されているRhoキナーゼ阻害剤を間質性肺炎・肺線維症の予防・治療に用いてみることに、当業者が格別の創意を要したものとはみとめられない。また、文書に関しても、医薬のパッケージとして通常用いられるものであって、当業者が通常実施する形態である。

したがって、請求の範囲1-10及び16-21に係る発明は進歩性を有さない。

PCT

国際調査報告

(法8条、法施行規則第40、41条)
〔PCT18条、PCT規則43、44〕

| | | | |
|--------------------------------|------------------|---|-------------------------|
| 出願人又は代理人 の書類記号 | 09352 | 今後の手続きについては、国際調査報告の送付通知様式(PCT/ISA/220)及び下記5を参照すること。 | |
| 国際出願番号 PCT/JP00/01728 | 国際出願日 (日.月.年) | 21.03.00 | 優先日 (日.月.年) 25.03.99 |
| 出願人(氏名又は名称) 吉 富 製 薬 株 式 会 社 | | | |

国際調査機関が作成したこの国際調査報告を法施行規則第41条(PCT18条)の規定に従い出願人に送付する。
この写しは国際事務局にも送付される。

この国際調査報告は、全部で 4 ページである。

☐ この調査報告に引用された先行技術文献の写しも添付されている。

1. 国際調査報告の基礎

a. 言語は、下記に示す場合を除くほか、この国際出願がされたものに基づき国際調査を行った。

☐ この国際調査機関に提出された国際出願の翻訳文に基づき国際調査を行った。

b. この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき国際調査を行った。

☐ この国際出願に含まれる書面による配列表

☒ この国際出願と共に提出されたフレキシブルディスクによる配列表

☐ 出願後に、この国際調査機関に提出された書面による配列表

☐ 出願後に、この国際調査機関に提出されたフレキシブルディスクによる配列表

☐ 出願後に提出した書面による配列表が出願時における国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった。

☒ 書面による配列表に記載した配列とフレキシブルディスクによる配列表に記載した配列が同一である旨の陳述書の提出があった。

2. ☒ 請求の範囲の一部の調査ができない(第I欄参照)。

3. ☐ 発明の単一性が欠如している(第II欄参照)。

4. 発明の名称は ☒ 出願人が提出したものを承認する。

☐ 次に示すように国際調査機関が作成した。

5. 要約は ☒ 出願人が提出したものを承認する。

☐ 第III欄に示されているように、法施行規則第47条(PCT規則38.2(b))の規定により国際調査機関が作成した。出願人は、この国際調査報告の発送の日から1カ月以内にこの国際調査機関に意見を提出することができる。

6. 要約書とともに公表される図は、

第 _____ 図とする。 ☐ 出願人が示したとおりである。

☒ なし

☐ 出願人は図を示さなかった。

☐ 本図は発明の特徴を一層よく表している。

第Ⅰ欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見 (第1ページの2の続き)

法第8条第3項 (PCT 17条(2)(a)) の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1. ☒ 請求の範囲 11-15 は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。つまり、
請求の範囲11ないし15に係る発明は、手術又は治療による人体の処置方法である。(PCT 17条(2)(a)(i)、PCT規則39.1(iv))
2. ☐ 請求の範囲 _____ は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、
3. ☐ 請求の範囲 _____ は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に従って記載されていない。

第Ⅱ欄 発明の単一性が欠如しているときの意見 (第1ページの3の続き)

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるところの国際調査機関は認めた。

1. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2. ☐ 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。
- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl' A61K45/00, 31/34, 31/44, 31/443, 31/445, 31/4525,
31/50, 31/501, A61P11/00

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl' A61K45/00, 31/34-31/501, A61P11/00

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAPLUS (STN), REGISTRY (STN), MEDLINE (STN),
WPI (DIALOG), BIOSIS (STN)

C. 関連すると認められる文献

| 引用文献の カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示 | 関連する 請求の範囲の番号 |
|-----------------|--|------------------|
| Y | WO, 98/06433, A1 (吉富製薬株式会社), 19. 2月. 1998 (19. 02. 98), 特許請求の範囲, 第4頁第8-18行, 第16頁21行-第18頁 第11行, 第54頁第16行-第55頁第21行, & AU, 9737851, A, & NO, 9900622, A, & CZ, 9900460, A3, & BR, 9711154, A, & CN, 1233188, A, & EP, 956865, A1 | 1-10, 16-21 |
| Y | JP, 10-113187, A (麒麟麦酒株式会社), 6. 5月. 1998 (06. 05. 98), 特許請求の範囲, 【0089】-【0108】, & US, 5906819, A | 1, 6, 16, 21 |

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)
「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

26. 05. 00

国際調査報告の発送日

13.06.00

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

今村 玲 英 子 印

4C

9736

電話番号 03-3581-1101 内線 3452

| C (続き) 関連すると認められる文献 | | |
|---------------------|--|------------------|
| 引用文献の カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示 | 関連する 請求の範囲の番号 |
| Y | EP, 893437, A1 (ONO PHARMACEUTICAL CO., LTD.), 27. 1月. 1999 (27. 01. 99), 特許請求の範囲, 第20頁第56行-第21頁第14行, & WO, 97/37969, A1, 特許請求の範囲, 第31頁第8行-第32頁第2行 | 1-10, 16-21 |
| Y | EP, 784980, A1 (NAKAMURA, Toshikazu), 23. 7月. 1997 (23. 07. 97), 特許請求の範囲, & JP, 9-300426, A, 特許請求の範囲, & WO, 95/29694, A1, & US, 5840311, A | 1-10, 16-21 |
| Y | EP, 519354, A1 (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO., LTD.), 23. 12月. 1992 (23. 12. 92), 特許請求の範囲, & JP, 5-221872, A, 特許請求の範囲, & US, 5279826, A, & CA, 2071425, A | 1-10, 16-21 |
| Y | JP, 6-345643, A (ヘキスト・アクチェンゲゼルシャフト), 20. 12月. 1994 (20. 12. 94), 特許請求の範囲, & EP, 627413, A1, & US, 5880156, A, & NO, 9402062, & CA, 2125105, 0A, & FI, 9402598, A, DE, 4318658, A1, & AU, 9464543, & NZ, 260660, A | 1-10, 16-21 |
| Y | JP, 61-158983, A (吉富製薬株式会社), 18. 7. 1986 (18. 07. 86), 第3頁右下欄 (ファミリーなし) | 1-10, 16-21 |
| Y | JP, 2-290821, A (ピアス株式会社), 30. 11. 1990 (30. 11. 90), 第2頁左上欄 (ファミリーなし) | 1-10, 16-21 |
| Y | JP, 10-218768, A (旭化成工業株式会社), 18. 8月. 1998 (18. 08. 98), 特許請求の範囲 (ファミリーなし) | 1-10, 16-21 |
| PA | WO, 00/09162, A1 (千寿製薬株式会社), 26. 2月. 2000 (26. 02. 00) (ファミリーなし) | 1-10, 16-21 |